

⑬ Int.Cl.<sup>5</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 平成2年(1990)1月25日

A 61 K 7/16

6971-4C

審査請求 未請求 請求項の数 5 (全5頁)

⑮ 発明の名称 歯口用組成物

⑯ 特 願 平1-126524

⑰ 出 願 平1(1989)5月19日

優先権主張 ⑱ 1988年5月19日 ⑲ イギリス(GB) ⑳ 8811830.2

⑳ 発 明 者 ニール・ジョン・ブリ オーストラリア国、エヌ・エス・ダブリュ・2322、ヤーラ  
ストウ ム・アベニュー・71㉑ 発 明 者 ビーター・カーター イギリス国、チエシャー、サウス・ウイラル、バートン、  
ザ・レイク、ブライアフィールド(番地なし)㉒ 出 願 人 ユニリーバー・ナーム オランダ国、ロッテルダム、バージミースターズ・ヤコブ  
ローゼ・ベンノートシ ブレーン・1  
ヤーブ㉓ 代 理 人 弁理士 川口 義雄 外2名  
最終頁に続く

## 明 細 書

## 1. 発明の名称

歯口用組成物

## 2. 特許請求の範囲

(1) 知覚鈍麻剤としてのカリウム及び／又はストロンチウムイオン源と粒状研磨剤を含む知覚感受性の歯を処置するための歯口用組成物であって、粒状研磨剤がヒドロキシアパタイトであるか若しくはヒドロキシアパタイトを含むことを特徴とする歯口用組成物。

(2) ヒドロキシアパタイトは 1~15 $\mu$ m の平均粒子サイズを有することを特徴とする請求項1に記載の組成物。

(3) ヒドロキシアパタイトが、少なくとも92重量%の  $\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$  を含む合成ヒドロキシアパタイトであることを特徴とする請求項1に記載の組成物。

(4) ヒドロキシアパタイトが 1~50重量%の量存在することを特徴とする請求項1に記載の組成物。

(5) 知覚鈍麻剤としてカリウム及び／又はストロンチウムイオン源を 1~10重量%含むことを特徴とする請求項1に記載の組成物。

## 3. 発明の詳細な説明

本発明は歯口用組成物(oral composition)、詳しくは知覚感受性の歯(sensitive teeth)に対する知覚鈍麻剤(desensitising agent)を含有する歯口用組成物に関する。

本発明の目的は、磨れた歯の知覚鈍麻作用を有する組成物を提供することにある。

本発明の新規な歯の知覚鈍麻性組成物は不溶性化合物及び溶解性化合物を含み、各化合物は歯の知覚を鈍麻させる作用を有し且つ不溶性化合物は歯の洗浄研磨剤としても作用する。

従って、本発明により提供される歯の知覚鈍麻

性歯口用組成物は、微細なヒドロキシアパタイトとカリウム及び／又はストロンチウムイオン源を含む。

微細なヒドロキシアパタイトを歯口用組成物の研磨剤として使用することは公知である(CA-A-999,238号明細書、USP 4,634,589号明細書及びUSP 4,327,079号明細書参照)が、カリウム及び／又はストロンチウムイオン源を含む製品中に微細なヒドロキシアパタイトを使用することは少しも教示されていない。

ヒドロキシアパタイト研磨剤としては、本発明の歯磨きを適量使用したとき歯の表面に害を与えることなく満足に洗浄し得る粒子サイズを有するものが使用される。その平均粒子サイズは通常約1~15 $\mu$ mであり、好ましくは2~10 $\mu$ m、特に好ましくは約3~10 $\mu$ mである。

本発明の歯口用組成物中に使用するのに適した

ある。

各種カリウム及びストロンチウム化合物が歯の知覚鈍麻剤として使用されることは文献に記載されている。USP 3,863,008号明細書(Hodosh)は窒化カリウムの使用を記載している。EP-A-95,871号明細書(Reckitt及びColman)はクエン酸カリウムの使用を記載している。PCT/US85/00123号明細書(The Trustees of Columbia University in the City of New York)は重炭酸カリウム及び塩化カリウムの使用を記載している。更に、酢酸カリウムも有効なカリウム化合物として本出願人の係属中の特許出願8706167に記載されている。

USP 3,122,483号明細書(Block Drug Co.)には、歯の知覚鈍麻剤として水溶性ストロンチウム化合物、例えば塩化ストロンチウム、乳酸ストロンチウム、酢酸ストロンチウム、臭化ストロンチウム、ヨウ化ストロンチウム、硝酸ストロンチウム及び

粒状ヒドロキシアパタイトは、少なくとも92重量%の $\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$ を含む高純度合成ヒドロキシアパタイトである。残部は主に結合水(典型的には最大6%)と少量の炭酸カルシウム(典型的には最大2%)からなる。ヒドロキシアパタイトの製造方法はGB-A-1,588,915号明細書(British Charcoals & Macdonalds)に記載されている。

高純度の合成ヒドロキシアパタイトはスコットランド、グリーンノックのBritish Charcoals & MacdonaldsからCAPITALの商品名で市販されている。このヒドロキシアパタイトは約97%の $\text{Ca}_{10}(\text{PO}_4)_6(\text{OH})_2$ を含み、残部の3%は約0.3%の炭酸カルシウムを含む主に結合水である。

本発明の歯口用組成物中に存在するヒドロキシアパタイトの量は組成物の1~50重量%であり、通常約2~20重量%、好ましくは3~15重量%で

サリチル酸ストロンチウムを使用することが記載されている。USP 3,699,221(Schole)には、有機のキレート剤及び無機金属イオン封鎖剤からなる群から選択された非毒性で水溶性のストロンチウム化合物例えばクエン酸ストロンチウム、エチレンジアミンテトラ酢酸ジナトリウム塩、グルコン酸ストロンチウム及びゲンチシン酸ストロンチウムを使用することが記載されている。

カリウム若しくはストロンチウムイオン源の量は、通常組成物の約1~20重量%、好ましくは約10重量%まで(例えば2~8重量%)、より好ましくは3~6重量%である。

ヒドロキシアパタイトの使用により奏効される別の効果として歯の無機質を再石灰化させ得る(remineralising)ことが、先行文献に記載されている。

本発明の歯口用製品には、ヒドロキシアパタイ

ト及びカリウム若しくはストロンチウムイオン類と一緒に製品の形態に応じて当業者に公知の慣用成分を含有させてもよい。例えば、磨り歯磨きの形態の製品の場合には、製品は潤滑剤含有液体相及び粒状固体研磨剤を液体相中に安定的に懸濁維持させるべく作用する結合若しくは増粘剤を含む。界面活性剤及び矯味剤(flavoring agent)は市販の歯磨きに慣用的に配合されている成分である。

一般的に使用される潤滑剤はグリセロール及びソルビトールシロップ(通常約70%の溶液からなる)である。しかしながら、当業者に公知の他の潤滑剤としてはプロピレングリコール、ラクチトール及び水系化コーンシロップが挙げられる。潤滑剤の量は通常歯磨きの約10~85重量%である。液体相の残部は実質的に水から構成される。

歯磨き中に使用される多数の結合若しくは増粘剤も公知である。好ましくはナトリウムカルボキ

アミント油及びペパーミント油をベースとするものである。他の矯味剤としては、メントール、チョウジ、冬樟油、ユーカリ油及びアニス油が例示される。歯磨き中に配合する矯味剤の適当な量は0.1~5重量%である。

本発明の歯口用組成物は、シリカ、アルミナ、水和アルミナ、炭酸カルシウム、無水リン酸ジカルシウム、リン酸ジカルシウム2水和物及び水不溶性メタリン酸ナトリウムのような補助研磨剤を含み得る。

本発明の歯口用組成物は、各種の任意成分を含み得る。これらの任意成分としては、殺菌性化合物(例えばクロロヘキシジン又は2,4,4'-トリクロロ-2'-ヒドロキシジフェニルエーテル)あるいは亜鉛塩(EP-A-161,898号明細書参照)のようなブラーク防止剤、結合リン酸塩(例えばアルカリ金属ピロリン酸塩、ヘキサメタリン酸塩

シメチルセルロース及びキサンタンガムである。他には、トラガントゴム、カラヤゴムやアラビアゴムの様な天然ゴム結合剤、トチャカ(Irish moss)、アルジネート及びカラジーンが挙げられる。シリカ増粘剤には、シリカエーロゲル及び各種沈降シリカが包含される。結合若しくは増粘剤を混合して使用してもよい。歯磨き中の結合若しくは増粘剤の量は通常0.1~10重量%である。

通常歯磨き中には界面活性剤も配合されており、適当な界面活性剤は文献に記載されている。実際に広く使用されている界面活性剤はラウリル硫酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム及びラウロイルサルコシン酸ナトリウムである。他のアニオン界面活性剤もカチオン、両性及びノニオン界面活性剤も使用され得る。界面活性剤は通常歯磨き中に0.5~5重量%の量存在する。

歯磨きに通常使用される矯味剤(flavor)はスベ

若しくはポリリン酸塩(USP 4,515,772号明細書及びUSP 4,827,977号明細書参照)あるいはクエン酸亜鉛(USP 4,100,269号明細書参照)のような歯石防止剤、フッ化ナトリウム又はモノフルオロリン酸ナトリウムのような含フッ素化合物、サッカリンのような甘味剤、二酸化チタンのような乳白剤、ホルマリンのような保存料、着色剤、酸塩基若しくは緩衝剤(例えば安息香酸)のようなpH調節剤が挙げられる。

歯口用組成物の処方に関しては、J. B. Wilkinson及びR. J. Moore編Harry's Cosmetology(第7版)1982, 609~617頁に詳しく記載されているので、参照されたい。

本発明は、歯にブラッシング等の方法で本発明の歯口用組成物を適用することからなる歯磨の予防方法にも関する。

以下、本発明の実施例を示す。パーセンテージ

及び部は重量基準である。

## 実施例 3 ～ 6

## 実施例 1 及び 2

下記成分から練り歯磨きを製造した。

下記成分から練り歯磨きを製造した。

(単位%)

成 分	実 施 例	
	1	2
ヒドロキシアパタイト	5.00	5.00
シリカエーロゲル (Gasil 23)	10.00	10.00
ソルビトールシロップ	40.00	40.00
ラウリル硫酸ナトリウム	1.50	1.50
ナトリウムカルボキシメチルセルロース	1.00	1.00
硝酸カリウム	3.00	—
塩化ストロンチウム	—	5.00
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.76	0.76
サッカリンナトリウム塩	0.20	0.20
二酸化チタン	1.00	1.00
ホルマリン	0.04	0.04
増臭剤	1.00	1.00
水	100.00まで	

(単位%)

成 分	実 施 例			
	3	4	5	6
ヒドロキシアパタイト	10.0	10.0	5.0	5.0
増粘性シリカ	10.0	10.0	10.0	10.0
ソルビトールシロップ (70%溶液)	40.0	40.0	40.0	40.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5	1.5	1.5	—
ナトリウムカルボキシメチルセルロース	1.0	1.0	1.0	1.0
硝酸カリウム	3.0	—	3.0	3.0
酢酸ストロンチウム	—	3.0	—	—
モノフルオロリン酸ナトリウム	0.8	0.8	0.8	0.8
トリクロサン (Triclosan)	0.2	—	—	—
ヘキセチジン	—	0.2	—	—
ポリエチレングリコール 300	6.0	—	—	—
クロロヘキシジンジグルコネート	—	—	0.1	0.1
塩化ストロンチウム	—	—	0.4	0.4
サッカリンナトリウム塩	1.2	0.2	0.2	0.2
二酸化チタン	1.0	1.0	1.0	1.0
ホルマリン	0.04	0.04	0.04	0.04
増臭剤	1.0	1.0	1.0	1.0
水	100.0 ま で			

第1頁の続き

⑫発 明 者

ブライオニー・エン  
マ・ユールソン

イギリス国、ウィラル、ポート・サンライト、ノックス・  
クロース・7

⑬発 明 者

マイケル・アルパー  
ト・トリブザン

イギリス国、ウィラル、ペビントン、ウォーレン・ヘイ・  
7